DialogWeb Command Mode

- For more records, click the Records link at page end.
- To change the format of selected records, select format and click Display Selected.
- To print/save clean copies of selected records from browser click Print/Save Selected.
  - To have records sent as hardcopy or via email, click Send Results.

✓ Select All

X Clear Selections

int/Save Selected

Send Result

Format Display Selected Free

3/5/1 DIALOG(R)File 352:Derwent WPI (c) 2007 The Thomson Corporation. All rts. reserv. ----

0003446194

WPI Acc no: 1985-218381/198536

XRAM Acc no: C1985-095095

New 1-phenyl-2-triazolyl alkane derivs. - useful as fungicides and plant growth regulators

Patent Assignee: HOECHST AG (FARH)

inventor: BURSTELL H; EHRHARDT H; HANDTE R; HARTZ P; MILDENBERG H; SACHSE B

Patent Family (3 patents, 7 countries)

Patent Number	Kind	Date	Application Number	Kind	Date	Update	Type
EP 153657	┫	19850904	EP 1985101520	A	19850213	198536	8
DE 3406908	lacksquare	19850905	DE 3406908	¥	19840225	198537	ш
JP 60202868	4	19851014	JP 198533702	A	19850223	198547	Ш

Priority Applications (no., kind, date): DE 3406908 A 19840225

Patent Details

Patent Number	Kind	lan	Pgs	Dra₩	Filing Notes
EP 153657	¥	DE	36	0	
Regional Designated States, Original	CH DE FR GB IT	E FF	₹ GB	IT LI	

## Alerting Abstract EP A

cycloalkyl or 6-14C bicycloalkyl, opt. substd. by 1-4C alkyl, or a gp. -CHR3R4; R2=halo; 1-4C halo-alkyl or -alkoxy with up to 5 halo; 1-6C alkyl, alkoxy or alkylthio; 5-7C cycloalkyl; 2-6C alkenyloxy; di(1-6C)alkylamino; NO2; CN; OH; 1-4C alkoxycarbonyl; Ph or PhO, or two Triazole derivs. of formula (I) metal salt complexes, acid addn. cpds. and quat. prods. are new: A=GO or CH(OH); RI=Ph or 3-7C

2/3 ページ

1–8C alkyl, NH2, 5–12C cycloalkylidene or benzylidene ), 1–4C alkyl-phenyl (1–2C)alkyl; amino; R6 and R7 together complete piperidino or R2 on adjacent C complete a 3-4C, hydrocarbon bridge; n=0-3; X=gp. (II)-(IV), S(O)mR5, NR6R7 or CHR8R9; R3=H or 1-4C alkyl, ; R4=H, R110CO. (1-4C)alkyl opt. substd. by NH2; R12S.CO(1-4C) alkyl; R6R7N.CO(1-4C)alkyl; 1-8C alkanoyl; PhCO, Ph or PhCH2; furfuryl; or 5-6 membered, opt. benzo-fused 1-3 O, S or N heteroatom-ring, opt. substd. by halo , ; R6=H, 1-8C alkyl or opt. halo-substd. Ph; R7=H, alkoxycarbonyl or CN; R10=1-4C alkyl; R11=H, 1-18C alkyl; 3-7C cycloalkyl; 3-6C alkenyl, 5-6C cycloalkenyl; 3-4C alkynyl; Ph; furfuryl; tetrahydrofurfuryl; or a cation equiv, of base; R12=1-6C alkyl, phenyl(1-2C)alkyl (opt. ring-substd. by 1 or 21-4C alkyl or halo, 3-6C 1-3C alkyl, 1-4C haloalkyl, 3-6C cycloalkyl, 6-14C bicycloalkyl , Ph or phenyl(1-4C)alkyl or 1-4C alkoxycarbonyl(1-4C)alkyl; m=0-2. morpholino or piperazino substd. at 4-position by 2-4C alkanoyl, 1-4C alkyl, Ph or PhCH2; R8 and R9=1-3C alkanoyl, PhCO, 1-3C R5=1-12C alkył; 2-6C alkenyi or alkynyi; 3-7C cycloalkyi; 1-6C alkyi substd. by NH2 or di(1-6C)alkylamino; dicarboxy(1-4C alkyl); alkenyl or Ph (opt. substd. by 1 or 2 1-4C alkyl or halo).

USE – (I) have fungicidal activity, esp. against the true mildews, and can also be used as wood preservatives and preservatives for paints, ubricants and cutting oils. .

Title Terms /Index Terms/Additional Words: NEW; PHENYL; TRIAZOLYL; ALKANE; DERIVATIVE; USEFUL; FUNGICIDE; PLANT; GROWTH: REGULATE

### Class Codes

# International Patent Classification

IPC	Class Scop	Scope Position Status	Status	Version Date
A01N-043/64		Main		"Version 7"
A01N-043/65; C07D-249/08; C07D-401/06; C07D-401/12; C07D-403/06; C07D-405/12; C07D-413/06		Secondary		"Version 7<

File Segment: CPI

DWPI Class: C02

Manual Codes (CPL/A-N); C06-H; C07-D13; C12-A02; C12-P01; C12-P02; C12-P09

Derwent WPI (Dialog & File 352). (c) 2007 The Thomson Corporation. All rights reserved.

Format	Asplay selected Free
	Send Results
	Print/Save Selected
J Solart All	X Clear Selections

(1) Veröffentlichungsnummer:

0 153 657

(12)

### **EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG**

Anmeldenummer: 85101520.6

Anmeldetag: 13.02.85

(5) Int. Cl.4: C 07 D 249/08

C 07 D 401/06, C 07 D 401/12 C 07 D 403/06, C 07 D 405/12

Priorität: 25.02.84 DE 8408908

Veröffentlichungstag der Anmeldung: 94.09.85 Patentblatt 95/36

Benannte Vertragsstaaten: CH DE FR GB IT LI

Anmelder: HOECHST AKTIENGESELLSCHAFT Poetfach 80 03 20 D-6280 Frankfurt am Main 90(DE)

Perfinder: Ehrhardt, Heinz, Dr. Bergstrasse 21 D-8901 Rehling(DE) (2) Erfinder: Mildenberger, Hilmar, Dr. Fasenenstrasse 24
D-6233 Keikheim (Taunus)(DE)

(72) Erfinder: Handte, Reinhard, Dr. Theilweg 23 D-8901 Gablingen(DE)

(2) Erfinder: Sachse, Burkhard, Dr. An der Ziegelei 30 D-6233 Kelkhelm (Taunus)(DE)

(72) Erfinder: Hartz, Peter, Dr. An der Ziegelei 28 D-6233 Kelkhelm (Taunus)(DE)

72 Erfinder: Bürstell, Helmut, Dr. Am Hohlacker 65 D-6000 Frankfurt am Main 50(DE)

Noue Triazolylajkylderivate, Verfahren zu lihrer Herstellung sowie ihre Verwendung als Pflanzenbehandlungsmittel.

Verbindungen der Formei (I),

$$R^{1} - A - CH - CH - CH - (R^{2})_{n}$$

Phenyl; R<sup>5</sup> und R<sup>5</sup> = Alkenoyi, Benzoyi, Alkoxycarbonyl oder Cyano bedeuten, sowie deren pflanzen-verträgliche Metallsalzkomiexe, Säureadditionsverbindungen und Quaternierungsprodukte besitzen vorteilhafte fungizide und pflanzenwachstumsregulatorische Wirkung.

worth A = eine Carbonylgruppe oder die Gruppierung -CH(OH)-; R1 = (subst.) Phenyl, (subst.) Alkyl, (subst. Cyclosikyl oder Bicyclosikyl; R2 = Halogen, (subst.) Alkyl, Cyclosikyl, (subst.) Alkoxy, Alkylthio, Alkenyloxy, Dialkylamino, Nitro, Cyano, Hydroxy, Alkoxycarbonyl, Phenyl, Phenoxy oder zwei Reste R2 eine C-Kette; n = 0, 1, 2 oder 3; X =  $-S(0)_mR^5$  (mit m = 0, 1 oder 2), subst.) Amino, (subst.) Piperidino, (subst.) Morpholino, CHR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>, (subst.)Triazolyl, (subst.) Pyrazolyl, (subst.) Pyrimidinyl; R<sup>5</sup> = (subst.) Alkyl, Alkenyi, Cycloalkyi, Aminoalkyi, Dialkylaminoalkyi, Dicarboxyalkyl, R11-O-CO-(amino)alkyl, R12-S-CO-alkyl; (subst.) Amino-CO-Alkyl, Alkenoyl, (subst.) Benzoyl, (subst.) Phenyl oder (subst.) Benzyl, Furfuryl oder einen O, S oder N-Heterocyclus; R11 = H, (subst.) Alkyl, Cycloalkyl, (subst.) Alkenyl, Cycloalkenyl, Alkinyl, (subst.) Phenyl, Furfuryl, Tetrahydrofurfuryl oder ein Kationäquivalent einer Basa; R12 - Alkyl, (subst.) Phenylalkyl, Alkenyl oder (subst.) Neue Triazolylalkylderivate, Verfahren zu ihrer Herstellung sowie ihre Verwendung als Pflanzenbehandlungsmittel

Es ist bekannt, daß bestimmte Triazolylalkylthioether (DE-A 31 08 770) fungizide und wuchsregulatorische Eigenschaften besitzen. Ihre fungizide Wirkung ist jedoch, insbesondere bei niedrigen Aufwandmengen und -konzentrationen, nicht voll befriedigend. Auch die pflanzenwachstumsregulierende Wirkung dieser Azolderivate ist nicht ausreichend.

Weiterhin ist bekannt, daß bestimmte Bisazolylverbindungen (DE-A 32 15 360) als Pflanzenwachstumsregulatoren wirken. Die Wirkung dieser Azolderivate ist jedoch
ebenfalls, insbesondere bei niedrigen Aufwandmengen und
-konzentrationen, unbefriedigend.

Es wurden nun neue Triazolylalkylderivate mit interessanten pflanzenwachstumsregulierenden und fungiziden Eigenschäften gefunden.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind daher die Ver-20 bindungen der Formel (I),

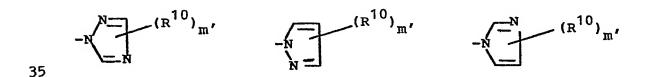
worin

25

5

A eine Carbonylgruppe oder die Gruppierung -CH(OH)-

Phenyl das gegebenenfalls bis zu dreifach durch  $R^{1}$ Halogen, Trifluormethyl, NO2, (C1-C4) Alkoxy, (C1-Ch) Alkyl und/oder einfach durch Phenyl, Phenoxy oder Halogenphenoxy substituiert ist gegebenenfalls durch (C1-C4)Alkyl substituiertes 5 Cyclo(C3-C7)alkyl oder Bicyclo(C6-C14)alkyl insbesondere [2.2.1] Bicycloheptyl, oder die Gruppierung -CHR3R4, in welcher Wasserstoff oder (C1-C4)Alkyl, insbesondere Methyl, R3Wasserstoff, (C1-C3)Alkyl, insbesondere Me- $R^{4}$ 10 thyl, Halogen(C1-C4)alkyl, Cyclo(C3-C6)alkyl, Bicyclo( $C_{6}-C_{14}$ )alkyl, insbesondere  $\mathbb{Z}_{2.2.17}$ -Bicycloheptyl, das durch  $(C_1-C_4)$ alkyl ein oder mehrfach substituiert sein kenn, Phenyl, Halogenphenyl, Phenyl- $(C_1-C_4)$ alkyl, Halogenphenyl- $(C_1-C_4)$ alkyl oder 15  $(C_1-C_4)$  Alkoxy-carbonyl- $(C_1-C_4)$  alkyl, Halogen, Halogen(C1-C4)alkyl oder Halogen(C1-C4)- $\mathbb{R}^2$ alkoxy mit jeweils bis zu 5 Halogenen, insbesondere Fluor oder Chlor, (C1-C6)Alkyl,  $Cyclo(C_5-C_7)$ alkyl,  $(C_1-C_6)$ Alkoxy,  $(C_1-C_6)$ -20 Alkylthio, (C2-C6)Alkenyloxy, Di(C1-C6)alkylamino, Nitro, Cyano, Hydroxy, (C1-C4) Alkoxycarbonyl, Phenyl, Phenoxy oder im Falle n = 2können zwei Reste R2 zusammen eine gegebenenfalls ungesättigte Kohlenwasserstoffkette mit 3 bis 4 C-25 Atomen bilden, die benachbarte Ringpositionen miteinander verbinden, 0, 1, 2 oder 3, wobei bei Mehrfachsubstitution die n Reste R2 verschiedene Bedeutungen besitzen können,  $-s(0)_{m}R^{5}$ ;  $-NR^{6}R^{7}$ ,  $CHR^{8}R^{9}$ , 30 X



### wobei

- u 0, 1 oder 2
- $(C_1-C_{12})$ Alkyl, das gegebenenfalls bis zu dreifach **R**5 durch Hydroxy, Halogen oder (C1-C4) Alkoxy substituiert ist, (C2-C6)Alkenyl, (C2-C6)Alkinyl, Cyclo- $(C_3-C_7)$ alkyl, Amino $(C_1-C_6)$ alkyl, Di $(C_1-C_6)$ alkylamino- $(C_1-C_6)$ alkyl, Dicarboxy- $(C_1-C_4)$ alkyl,  $R11_{-0-C0-(C_1-C_4)}$ alkyl, das im  $(C_1-C_4)$ Alkylteil durch Amino substituiert sein kann, R12-S-CO- $(C_1-C_4)$  alkyl,  $R_{R_7N-CO-(C_1-C_4)}$  alkyl,  $(C_1-C_8)-$ 0 Alkanoyl, Benzoyl, Phenyl oder Benzyl, wobei die drei letztgenannten Reste gegebenenfalls ein oder zweifach durch Halogen oder eine Carboxygruppe substituiert sein können, Furfuryl oder einen fünfoder sechsgliedrigen, gegebenenfalls benzo-5 kondensierten Ring mit 1-3 Heteroatomen aus der Gruppe O, S und N, bevorzugt Pyridyl, wobei der Heterocyclus durch Halogen substituiert sein kann mit der Maßgabe, daß für  $R^5 = (C_1 - C_8)$ Alkanoyl oder Benzoyl m = 0 sein  $mu\beta$ , 20
  - R6 Wasserstoff, (C1-C8)Alkyl, gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Phenyl,
- Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)Alkyl, das gegebenenfalls bis zu dreifach durch Phenyl, Hydroxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkoxy, Cyano, Carboxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy-carbonyl substituiert ist, Amino, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl[phenyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkyl]-amino, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylidenamino, Cyclo(C<sub>5</sub>-C<sub>12</sub>)alkylidenamino, Benzylidenamino, wobei der letztgenannte Rest im Phenylkern durch Halogen, Cyano oder Phenoxy substituiert sein kann, oder
- 35 R6 und R7 zusammen mit dem N-Atom, das die beiden Reste

trägt, einen Piperidinring oder Morpholinring, die gegebenenfalls durch (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl substituiert sein können, insbesondere 3,5-Dimethylpiperidinyl und 3,5-Dimethylmorpholinyl, sowie einen Piperazinring, der in Position 4 durch (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)Alkanoyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, Phenyl oder Benzyl substituiert ist, wobei die beiden letztgenannten Reste durch Halogen oder CF3 substituiert sein können,

- 10  $R^8$ ,  $R^9$  unabhängig voneinander ( $C_1-C_3$ )Alkanoyl, Benzoyl, ( $C_1-C_3$ )Alkoxycarbonyl oder Cyano,
  - $R^{10}$  (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl,
- $R^{11}$ 15 H, (C1-C18) Alkyl, das gegebenenfalls bis zu dreifach durch Halogen, vorzugsweise Fluor, Chlor, oder Brom, Hydroxy, (C1-C6)Alkoxy, (C1-C4)Alkylthio,  $(C_1-C_6)$  Alkoxy- $(C_2-C_6)$  alkoxy,  $(C_1-C_4)$  Alkylamino,  $Di(C_1-C_4)$ alkylamino, Phenyl oder  $(C_1-C_4)$ Alkoxy-20 carbonyl substituiert ist, Cyclo(C3-C7)alkyl, (C3-C6)Alkenyl, Halogen(C3-C6)alkenyl, Cyclo-(C5-C6)alkenyl, (C3-C4)Alkinyl, das gegebenenfalls ein- oder zweifach durch (C1-C6)-Alkyl, Phenyl, Halogen oder (C1-C2) Alkoxy 25 substituiert ist, Phenyl, das gegebenenfalls einbis dreifach durch  $(C_1-C_4)$ Alkyl,  $(C_1-C_4)$ Alkoxy, Halogen, NO2 oder CF3 substituiert ist, Furfuryl, Tetrahydrofurfuryl oder ein Kationäquivalent einer organischen oder anorganischen Base, insbesondere NH4, Mono-, Di-, Tri(C1-C4)alkylammonium, Benzyl-30 tri(C1-C4)alkylammonium, Natrium oder Kalium,
- R12 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl, Phenyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkyl, wobei der
  Phenylrest ein- oder zweifach durch (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl
  oder Halogen substituiert sein kann, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)Alkenyl oder Phenyl, das ein- oder zweifach durch
  (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl oder Halogen substituiert sein kann,

bedeuten, sowie deren pflanzenverträgliche Metallsalzkomplexe, Säureadditionsverbindungen und Quaternisierungsprodukte.

Die Reste Halogenphenoxy, Halogenphenyl, Halogenphenylalkyl enthalten bevorzugt 1 bis drei Halogenatome, insbesondere Flur oder Clor.

Bevorzugt von den Definitionen für den Rest R<sup>2</sup> sind Halogen, insbesondere Fluor und Chlor, Halogen(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)
alkyl, insbesondere CF<sub>3</sub>, Halogen(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy, insbesondere fluoriertes Alkoxy, besonders bevorzugt OCF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>H und OCF<sub>3</sub>, und (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy-carbonyl, insbesondere -CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>.

Weiterhin werden solche Verbindungen der Formel (I) bevor
\*\*sugt, bei denen X für SR5, NR6R7 oder Triazol steht.

Die Verbindungen der Formel (I) besitzen zwei asymmetrische Kohlenstoffzentren; sie können deshalb in Form ihrer reinen Stereoisomeren oder als Stereoisomerengemische Vorliegen; diese werden alle von vorliegender Erfindung erfaßt.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist ferner ein Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I),

5 sowie deren Metallsalzkomplexe, Säureadditionsverbindungen und Quaternisierungsprodukte, bei dem man eine Verbindung der Formel (II)

$$R^{1} - C - C = CH - (R^{2})_{n}$$
(II)

5 mit einer Verbindung der Formel (III)

30

$$H - X_i$$
 (III)

worin X' die für X genannten Reste mit Ausnahme von -SOR5 und SO2R5 bedeutet, umsetzt, die erhaltenen Verbindungen der Formel (I), worin A eine Carbonylgruppe bedeutet, gegebenenfalls zu Verbindungen der Formel (I), worin A die Gruppe -CH(OH)- bedeutet, reduziert, die erhaltenen Verbindungen der Formel (I) im Falle  $X = SR^5$ gegebenenfalls zu Verbindungen der Formel (I) mit  $X = SOR^5$ oder SO<sub>2</sub>R5 oxidiert und die Verbindungen der Formel (I) gegebenenfalls in ein Säureadditionssalz, Komplexsalz oder Quaternisierungsprodukt überführt. 10

5

Die Vinyltriazol-Derivate der Formel (II) sind teilweise bekannt (vgl. JP-A 53 130 661; DE-A 28 38 847, DE-A 30 10 560, DE-A 29 29 602 und DE-A 30 00 643). Sie können nach den dort angegebenen Verfahren erhalten wer-15 · den, in dem man beispielsweise Ketone mit Benzaldehyden in üblicher Weise in Gegenwart eines inerten organischen Lösungsmittels, wie beispielsweise Toluol, und in Gegenwart eines Katalysators, wie beispielsweise Piperidinacetat, bei Temperaturen zwischen 20° und 160°C, 20 insbesondere bei der Siedetemperatur des jeweiligen Lösungsmittels, umsetzt.

Die Vinyltriazol-Derivate der Formel (II) kommen in den geometrischen Isomeren E (trans) und Z (cis) vor. Sie 25 können sowohl als E/Z-Isomerengemisch als auch in Form der reinen Isomeren eingesetzt werden.

Die Verbindungen der Formel (III) sind allgemein bekann:; von diesen seien beispielsweise genannt: 30 Ethylmercaptan, Methylmercaptan, 2-Aminoethylmercaptan, Thioglykolsäure, Thioäpfelsäure, Cystein, Thioessigsäure, Thiobenzoesäure, 2-Hydroxy-ethylmercaptan, 2,3-Dihydroxypropylmercaptan, Thiophenol, 4-Chlorbenzylmercaptan, Thiosalicylsäure, Furfurylmercaptan, 2-Mercaptobenz-35

thiazol, 6-Chlor-2-mercaptobenzoxazol, 2-Mercaptotriazol, 2-Mercaptopyridin, 2-Mercaptopyrimidin,
2-Mercaptothiazolin, Propylamin, Cyanmethylamin,
2-Phenylethylamin, 2-Methoxy-ethylamin, Methylhydrazin,
Dimethylhydrazin, Cyclohexylidenmethylhydrazin, Piperidin, Morpholin, 1-Acetyl-piperazin, 1-(3-Trifluormethylphenyl)-piperazin, 1-Benzyliperazin, Acetylaceton,
Dibenzoylmethan, Benzoylaceton, Malonsäurediethylester,
Cyanessigsäureethylester.

10

15

5

Die Umsetzungen der Verbindungen der Formel (II) mit Verbindungen der Formel (III) werden in der Regel in Gegenwart eines inerten organischen Lösungsmittels durchgeführt. Geeignet sind beispielsweise Ketone, vorzugsweise Aceton und Methylethylketon, Alkohole, vorzugsweise Methanol, Ethanol und Isopropanol, Nitrile, vorzugsweise Acetonitril und Propionitril, aromatische Kohlenwasserstoffe, vorzugsweise Benzol, Toluol oder Xylol sowie Ether, vorzugsweise Diethylether oder Tetrahydrofuran.

20

25

Ferner kann bei dieser Reaktion als Katalysator eine Base zugesetzt werden. Hierfür kommen in Frage: Alkalimetall-akoholate, wie Natrium- oder Kaliummethylat oder -ethylat, Alkalimetallamide, wie Natrium- oder Kalium- amid, Alkalimetallhydride, wie Natriumhydrid sowie vorzugsweise tertiäre organische Amine, wie Trialkylamine, insbesondere Triethylamin, Pyridin oder Diazabicyclo- octan.

30

Die Reaktionstemperaturen können in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man zwischen 0° und 120°C, vorzugsweise bei 20° bis 80°C.

Für die Reduktion der Verbindungen der Formel (I), worin A eine Carbonylgruppe bedeutet, eignen sich als Reduktions-

mittel bevorzugt komplexe Hydride, insbesondere Natriumborhydrid. Man arbeitet in Gegenwart eines Lösungsmittels, insbesondere eines Alkohols, vorzugsweise Methanol, bei Temperaturen zwischen 0° und 100°C, vorzugsweise 25° bis 60°C.

5

10

15

20

30

35

Die Oxidation der Verbindungen der Formel (I) mit  $X = SR^5$  erfolgt mit üblichen Oxidationsmitteln wie  $H_2O_2$ , Peressigsäure, m-Chlorperbenzoesäure, Perjodsäure, Chromsäue, Kaliumpermanganat nach bekannten üblichen Methoden.

Die neuen Azolylalkylderivate sind als basische Verbindungen zur Bildung von Salzen, Komplexsalzen und Quaternisierungsprodukten befähigt. Genannt seien Salze mit organischen und anorganischen Säuren, wie Acetate, Fumarate, Oxalate, Benzoate, Phenolate, Nitrate, Bromide, Chloride, Sulfate, Sulfonate, Komplexe mit Metallen der Gruppe Ib, IIb, IVb oder VIII des Periodensystems, insbesondere mit Kupfer, Zink, Zinn und Nickel sowie Quaternisierungsprodukte mit (C1-C6)Alkyl- und Phenacylhalogeniden. Die Herstellung derartiger Derivate erfolgt nach allgemein üblichen Methoden.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen besitzen intensive pflanzenwachstumsregulierende und mikrobiozide Wirkungen.

So zeichnen sie sich durch hervorragende fungizide Wirksamkeit aus. Selbst in das pflanzliche Gewebe eingedrungene pilzliche Krankheitserreger lassen sich erfolgreich kurativ bekämpfen. Dies ist besonders wichtig und vorteilhaft bei solchen Pilzkrankheiten, die nach eingetretener Infektion mit den sonst üblichen Fungiziden nicht mehr wirksam bekämpft werden können. Das Wirkungsspektrum der neuen Verbindungen erfaßt ferner eine Vielzahl verschiedener phytopathogener Pilze, wie z.B. Piricularia oryzae, Plasmopara viticola, verschiedene Rostarten, Pellicularia sasakii, Venturia inaequalis und Cercospora beticola, vor allem aber echte Mehltaupilze im Obst-, Gemüse-, Getreide- und Zierpflanzenbau.

Die Verbindungen der Formel (I) eignen sich ferner für den Einsatz in technischen Bereichen, beisielsweise als Holzschutzmittel, als Konservierungsmittel in Anstrichfarben, in Kühlschmiermitteln für die Metallbearbeitung oder als Konservierungsmittel in Bohr- und Schneideölen.

5

10

. }.

20

30

Die erfindungsgemäßen Substanzen weisen außerdem hervorragende wachstumsregulatorische Eigenschaften bei Kulturpflanzen auf. Sie greifen regulierend in den pflanzeneigenen Stoffwechsel ein und können damit zur gezielten Beeinflussung von Pflanzeninhaltsstoffen und zur Ernteerleichterung wie z.B. durch Auslösen von Desikkation und Wuchsstauchung eingesetzt werden. Des weiteren eignen sie sich auch zur generellen Steuerung und Hemmung von unerwünschtem vegetativen Wachstum, ohne dabei die Pflanzen abzutöten. Eine Hemmung des vegetativen Wachstums spielt bei vielen mono- und dikotylen Kulturen eine große Rolle, da das Lagern hierdurch verringert oder völlig verhindert werden kann. Besonders hervorzuheben ist die wachstumsregulatorische Wirksamkeit der Verbindungen als Wuchshemmer in Getreide, Mais, Soja, Baumwolle, Rasen sowie ihre Fähigkeiten, den Gehalt an erwünschten Inhaltsstoffen wie Kohlehydraten und Protein bei Nutzpflanzen zu erhöhen. Schließlich zeigen die Verbindungen eine sehr gute Verbesserung der Fruchtabszission, insbesondere bei Zitrusfrüchten, oder eine Reduktion der Haltekraft.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind daher auch pflanzenwachstumsregulierende und fungizide Mittel, die die obengenannten Verbindungen der Formel (I) oder deren Metallsalzkomplexe, Säureadditionsverbindungen und Quaternisierungsprodukte enthalten.

Die Mittel können als Spritzpulver, emulgierbare Konzentrate, versprühbare Lösungen, Stäubemittel, Beizmittel, Dispersionen, Granulate oder Mikrogranulate in den üblichen Zubereitungen angewendet werden.

Unter Spritzpulvern werden in Wasser gleichmäßig dispergierbare Präparate verstanden, die neben dem Wirkstoff
außer gegebenenfalls einem Verdünnungs- oder Inertstoff
noch Netzmittel, z.B. polyoxethylierte Alkylphenole,
polyoxethylierte Fettalkohole, Alkyl- oder Alkylphenylsulfonate und Dispergiermittel, z.B. ligninsulfonsaures
Natrium, 2,2'-dinaphthylmethan-6,6'-disulfonsaures
Natrium, dibutylnaphthalinsulfonsaures Natrium oder auch
oleoylmethyltaurinsaures Natrium enthalten. Ihre Herstellung erfolgt in üblicher Weise z.B. durch Mahlen und
Vermischen der Komponenten.

5

10

30

Emulgierbare Konzentrate können z.B. durch Auflösen des Wirkstoffes in einem inerten organischen Lösungsmittel, z.B. Butanol, Cyclohexanon, Dimethylformamid, Xylol oder 15<sup>°</sup> auch höhersiedenden Aromaten oder Kohlenwasserstoffen unter Zusatz von einem oder mehreren Emulgatoren hergestellt werden. Bei flüssigen Wirkstoffen kann der Lösungsmittelanteil ganz oder auch teilweise entfallen. Als Emulgatoren können beispielsweise verwendet werden: 20 Alkylarylsulfonsäure Calciumsalze wie Ca-dodecylbenzolsulfonat, oder nichtionische Emulgatoren wie Fettsäurepolyglykolester, Alkylarylpolyglykolether, Fettalkoholpolyglykolether, Propylenoxid-Ethylenoxid-Kondensationsprodukte, Alkylpolyglykolether, Sorbitanfettsäureester, 25 Polyoxethylensorbitanfettsäureester oder Polyoxethylensorbitester.

Stäubemittel werden durch Vermahlen des Wirkstoffes mit fein verteilten, festen Stoffen, z.B. Talkum, natürlichen Tonen wie Kaolin, Bentonit, Pyrophillit oder Diatomeenerde erhalten.

Granulate können entweder durch Verdüsen des Wirkstoffes auf adsorptionsfähiges, granuliertes Inertmaterial herge-

stellt werden oder durch Aufbringen vn Wirkstoffkonzentraten mittels Bindemitteln, z.B. Polyvinylalkohol,
polyacrylsaurem Natrium oder auch Mineralölen auf die
Oberfläche von Trägerstoffen wie Sand, Kaolinite oder von
granuliertem Inertmaterial. Auch können geeignete Wirkstoffe in der für die Herstellung von Düngemittelgranulaten üblichen Weise – gewünschtenfalls in Mischung mit
Düngemitteln – granuliert werden.

5

20

30

In Spritzpulvern beträgt die Wirkstoffkonzentration etwa 10 bis 90 Gew.-%; der Rest zu 100 Gew.-% besteht aus üblichen Formulierungsbestandteilen. Bei emulgierbaren Konzentraten kann die Wirkstoffkonzentration etwa 10 bis 80 Gew.-% betragen. Staubförmige Formulierungen enthalten meistens 5 bis 20 Gew.-% an Wirkstoff, versprühbare Lösungen etwa 1 bis 20 Gew.-%. Bei Granulaten hängt der Wirkstoffgehalt zum Teil davon ab, ob die wirksame Verbindung flüssig oder fest vorliegt und welche Granulierhilfsmittel. Füllstoffe usw. verwendet werden.

Daneben enthalten die genannten Wirkstofformulierungen gegebenenfalls die jeweils üblichen Haft-, Netz-, Dispergier-, Emulgier-, Penetrations-, Lösungsmittel, Füll- oder Trägerstoffe.

Zur Anwendung werden die in handelsüblicher Form vorliegenden Konzentrate gegebenenfalls in üblicher Weise verdünnt, z.B. bei Spritzpulvern, emulgierbaren Konzentraten, Dispersionen und teilweise auch bei Mikrogranulaten mittels Wasser. Staubförmige und granulierte Zubereitungen sowie versprühbare Lösungen werden vor der Anwendung üblicherweise nicht mehr mit weiteren inerten Stoffen verdünnt.

35 Auch Mischungen oder Mischformulierungen mit anderen

Wirkstoffen, wie z.B. Insektiziden Akariziden, Herbiziden, Düngemitteln, oder weiteren Wachstumsregulatoren oder Fungiziden sind gegebenenfalls möglich.

- Die benötigten Aufwandmengen der Verbindungen der Formel (I) können je nach Indikation innerhalb weiter Grenzen schwanken und variieren auch in Abhängigkeit von äußeren Bedingungen wie Bodenverhältnissen und Klimabedingungen. Im allgemeinen liegen sie jedoch zwischen 0,01 10 kg Wirkstoff/ha. Im Falle der Anwendung als Pflanzenwachstumsregulatoren variieren die Aufwandmengen insbesondere im Bereich zwischen 0,15 und 1,25 kg/ha, im Falle der fungiziden Anwendung insbesondere zwischen 0,15 bis 0,5 kg/ha.
- Die folgenden Beispiele dienen der weiteren Erläuterung der Erfindung.

### A. Formulierungsbeispiele

5

10

- a) Ein Stäubemittel wird erhalten, indem man 10 Gew.-Teile Wirkstoff und 90 Gew.-Teile Talkum als Inertstoff mischt und in einer Schlagmühle zerkleinert.
- b) Ein in Wasser leicht dispergierbares, benetzbares Pulver wird erhalten, indem man 25 Gew.-Teile Wirkstoff, 64 Gew.-Teile kaolinhaltigen Quarz als Inertstoff, 10 Gew.-Teile ligninsulfonsaures Kalium und 1 Gew.-Teil oleoylmethyltaurinsaures Natrium als Netz- und Dispergiermittel mischt und in einer Stiftmühle mahlt.
- c) Ein in Wasser leicht dispergierbares Dispersionskonzentrat stellt man her, indem man 20 Gew.-Teile Wirkstoff mit 6 Gew.-Teilen Alkylphenolpolyglykolether
  (z.B. (R) Triton X 207, von Rohm & Haas & Co.), 3 Gew.Teilen Isotridecanolpolyglykolether (8 AeO) und 71
  Gew.-Teilen paraffinischem Mineralöl (Siedebereich z.B.
  ca.255 bis über 377°C) mischt und in einer Reibkugelmühle auf eine Feinheit von unter 5 Mikron vermahlt.
- d) Ein emulgierbares Konzentrat läßt sich herstellen aus 15 Gewichtsteilen Wirkstoff, 75 Gewichtsteilen Cyclohexanon als Lösungsmittel und 10 Gewichtsteilen oxethyliertes Nonylphenol (10 AeO) als Emulgator.

### B. Herstellungsbeispiele

### Beispiel 1

5 l-(4-Chlorphenyl)-1-ethylthio-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-3-pentanon

Man suspendierte 27,7 g (0,1 mol) 1-(4-Chlorphenyl)-4methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on in 60 ml

Ethanol, setzte 0,3 ml Triethylamin zu und versetzte mit
6,2 g (0,1 mol) Ethylmercaptan. Es entstand eine klare
Lösung, aus der nach kurzer Zeit farblose Kristalle
ausfielen. Man rührte 2 h bei Raumtemperatur nach und
isolierte durch Absaugen 28,6 g (85 % d.Th.) einer farblosen Substanz vom Schmp. 143-5°C als Diastereomerengemisch.

In analoger Weise wurden die Verbindungen der nachfolgenden Tabelle I hergestellt.

Tabelle I

					0153657
Bei-	Aus	gangsmateri	.alien		Verfahrens-
spiel	R <sup>1</sup> C-C=CH-	(II)	HX'(III)		produkte
	R <sup>1</sup>	(R <sup>2</sup> ) <sub>n</sub>	x¹	A	Smp (°C)
2	СНз	2,4-Cl <sub>2</sub>	s-{O}	co	Oel
3	u	2-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	s Coci	11	II
4	11	n :	N-NH 2 I CH 3		114-5
5	(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH-	4-Cl	N=N	н	136-8
5	н	84	SC <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	71	93
7	п	н .	s-{O}	tı	158
В	n	н	s-Oc1	ti	151-2 .
9	n	н	SCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	. u	112-3
10	н	11	SCH <sub>2</sub> CH-CH <sub>2</sub> I I OH OH	11	153-4
11	.H	·* :	CH- (COCH 3) 2.	u	_ 165-6
12	n .	2,4-Cl <sub>2</sub>		\$1	148
13	n	4-C1 .	NCH 2 CH 2-O	"	Oel
14	n	n	NCH-CH-O	н	Oel

Bei- spiel	R <sup>1</sup>	(R²) <sub>n</sub>	X <sup>1</sup>	A	Smp (°C)
15	(CH₃) 2CH	4-Cl	CH <sub>3</sub> N-N-CH <sub>2</sub> -O	со	Oel
16	11	н .	NCH2CH2OCH3	u	98-9
17	u	n .	N-CH₂CN H	11	141-2
18	11	N	N-N=CH <sub>3</sub>	π	Oel
19	11	ıı .	NHC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	n	94-6
20	"	Ħ	SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )	2 "	Oel .
21	11	ts .	s-{	н	137-9
22	11	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	s{O}-c1 .	н	129-30
23	в .	2,4-Cl <sub>2</sub>	N	n	129-30
24	n	39	N O	п	amorph
25	n	H	N	-π	Oel
26	и .	11	NN (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> H	n	142 (Zers.)
27	n ·	н	SCH 2 CHOHCH 2 OH		Oel
28	31	4-c1	SCH -COOH	n	128-9
29	i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	n	s-O-cı	11	131-2

Bei- spiel	, 면 <sup>1</sup>	(R <sup>2</sup> ) <sub>n</sub>	х'	A	Smp (°C)
30 31	1-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	4-Cl	SCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> SCH <sub>2</sub> CHOHCH <sub>2</sub> OH	co "	Oel 138
32	11	2,4-Cl <sub>2</sub>	s-(O)	n	Oel
33 34	11	n 2-CO₂CH₃	SCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> SCH <sub>2</sub> CHOHCH <sub>2</sub> OH	11	11 11
35 36	c1-{O}-	4-Cl	SCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	. 11	" 116-9
37	CH <sub>3</sub>	2-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	s-O-c1	**	Oel
38	ff	n	N-NH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		1145
39	11	4-C1	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	ıı	Oel
40	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	2,4-Cl <sub>2</sub>	SCH 2 CH 2 NH 2	n	175-86
41	11	ts	N-CH <sub>3</sub>	"	112-4
42	u	4-Cl	$N \longrightarrow N \longrightarrow O$		112-3
43	3 <del>4</del> 1	·	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	·	143-5
44	,,	11	SC (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	"	183-4
45	и .	n :	SCOCH <sub>3</sub> .	n	158-60
46	п	11	SCH <sub>2</sub>	••	122-3
47	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	u	SCHCOOH CH <sub>3</sub>	'n	128-9

<u> </u>		<i>t</i> -2. 1			
Bei-	R <sup>1</sup>	(R <sup>2</sup> ) <sub>n</sub>	X t	A	Smp (°C)
spiel	•				
48	-	4.07.	<b>2</b>		
40	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	4-C1	S-CHCH <sub>2</sub> COOH	СО	196-8
49	94		COOH		466.7
49			SCH <sub>2</sub> CHCOOH I NH <sub>2</sub>		166-7
50	n	и	S-(O)-OH	п	203-6
			5 (0)-011		203-0
51	n	2,4-Cl <sub>2</sub>	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	ge .	Oel
52	i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	ш	S-C (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	<b>41</b>	140-1
53	(o)-	н	$N \longrightarrow O$	111	137-8
			CF <sub>3</sub>		- 0.0
			_ 013		
54	п	4-Cl	SCOCH <sub>3</sub>	22	174-6
			<b>√</b> -31\		
55	n	#	sco-{O}	**	130-2
56	п	п	SCH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	н	157-9
	п.		s O		
57			ноос	п	168-70
58				u	447.0
59		2,4-Cl <sub>2</sub>	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>		147-8
1		2,4-012	· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·		133-4
60	C1	4-C1	S-Сн-Сн₂СООН	ST	201-2
		. 01	соон		201 2
61	н -	2-CO2CH3	SCH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub>	tr	0el
			ОНОН		
62	π	n .	ŅN (СН <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Н	н	n n
l			н		
63	iC3H7	4-C1	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Сн (он)	tı
64	(0)	2,4-Cl <sub>2</sub>	н	81	π
0.3		1 213-CL2		١.	

zei- zpiel	R1	(R <sup>2</sup> ) <sub>n</sub>	X'	A	Smp.°C
65	СН3	4-Cl	SCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	co	Ö1
66	11	11	SCH2CO <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (1)	11	81
67	11	71	SCH2CO2CH2CH(C2H5)2	11	81
68	*1	11	SCH2CH2OH	11	81
69	11	11	SCH2CH(OH)CH2OH	76	81
70	n	11	NH-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	11	81
71	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	†1	SCH2CO2CH3	11	Öl
72	11	n	. SCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	11	Öl
73	11	11	SCH(CH <sub>3</sub> )CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	n ·	81
74	78	11	SCH2CH2OH .	11	81
<b>7</b> 5	11	11	SCH2CH(OH)CH2OH	11	<b>წ</b> 1
76	11	11	S-C6H4-4-C1	11	137-8
77	(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH	11	SCH2CO2C2H5	11	103-5
78	11	11	SCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (1)	11	99-102
79	11	п.	SCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>11</sub> (cyclo)	11	105
80	11-	11	SCH2CO2C6H13	11	97-9
81	11	t1	SCH2CO2C12H25	11	44-6
82	n	11	SCH2CO2CH2CH(C2H5)2	11	6570
83	11	11	"	CH(OH)	Ö1
84	n	99	SCH(CH <sub>3</sub> )CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CO	76-80
85	n	11	SCH(CH <sub>3</sub> )CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	11	Ö1
86	11	ti	SCH(CH <sub>3</sub> )CO <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (1)	17	81
87	11	n	SCH(CH3)CO2CH2CH2OCH3	ŦŤ	Ö1
88	11	11	SCH2CO2CH2CH2OCH3	Ħ	Öl
89	11	4-C1	SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	11	139-40
90	и .	<b>11</b>	S-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub> (cyclo)	n	111-3
91	п	11	S-CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	11	108-13
92	11	4-F	S-C6H4-4-C1	It	149-50

•

grei-		(R <sup>2</sup> ) <sub>n</sub>	Χ'	A	Smp.°C
T					
02	(011-) 011	4-F	gati co att	~	
93 94	(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH	H H	SCH2CO2CH3	<b>CO</b>	101-2
95	11	}	SCH <sub>2</sub> CH(OH)CH <sub>2</sub> OH	11	116–7
96	11	4-00 <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	S CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	11	წ <u>1</u>
97	11	Ji CO-CII	S-C6H4-4-C1	"	92-3
98	11	4-co <sub>2</sub> cH <sub>3</sub>		11	142-4
	"		SCH(CH <sub>3</sub> )CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	"	81
99	11	3–Br	S-C6H4-4-C1	"	132-4
100	n	11	SCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	11	81 83
i i	11	11	.SCH(CH3)CO2CH2CH2OCH3	11	81
102			SCH <sub>2</sub> CH(OH)CH <sub>2</sub> OH	rt	<u>გე</u>
103	. "	2-Cl	ingry do det	n	Öl.
104		11	SCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	11 11	81. 83.
105	n ·		$SCH(CH_3)CO_2C_3H_7$ (1)	11	81
106	"	2-0CH <sub>3</sub> .	S-C6H4-4-C1	11	59-61
107	"	11	SCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	11	81
108	"	11	SCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>		δ1. 
109			SCH <sub>2</sub> CH(OH)CH <sub>2</sub> OH	11	Ö1
110		H	S-C6H4-4-C1	11	130-2
111	"		SCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	11	113-5
112	n n	11	SCH(CH <sub>3</sub> )CO <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (1)	11	81
113		11	SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	11	144-6
114	(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub>	3-C1	SCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	11	Ö1
115	"	11	SCH2CH(OH)CH2OH	11	Ö1.
116	CH <sub>3</sub>	4-C1	S-C6H4-4-C1	Ħ	Ö1
117		11 .	SCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	n	Öl
118	СН3ОССН2СН2 О	11	S-C6H4-4-C1	u	87-8
119		11	SCH2CO2CH3	tt	Ö1

Bei- spiel	R <sup>1</sup>	$(R^2)_n$	χ·	Α	Smp.°C
120 (	СН3 4) С1—С6Н <sub>4</sub> —С—СН <sub>2</sub> 6 СН3	11	SCH2CO2CH3	11	Ö1.
121	11	11	SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	. 11	132-4
122	С6H <sub>5</sub>	11	11	11	146-7
123	11	11	NH-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	11	<b>81</b>
124	11	11	SCH2CO2CH3	11	109-11
125	11	**	SCH2CO2C2H5	11	106-8
126	11	"	SCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> SCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	11	<u>წ</u> ე
127	11	11	S-C6H5	18	149-51
129	11	11	11	CH(OH)	164-7

### C. Biologische Beispiele

### Beispiel 1

Weizenpflanzen wurden im 3-Blattstadium mit Konidien des Weizenmehltaus (Erysiphe graminis) stark inokuliert und in einem Gewächshaus bei 20 °C und einer relativen Luftfeuchte von 90 - 95 % aufgestellt. 3 Tage nach Inokulation wurden die Pflanzen mit den zu prüfenden Verbindungen in den Wirkstoffkonzentrationen von 500, 250 und 125 mg/Liter Spritzbrühe tropfnaß gespritzt. Nach einer Inkubationszeit von 10 Tagen untersuchte man die Pflanzen auf Befall mit Weizenmehltau.

Der Befallsgrad wird ausgedrückt in % befallener Blattfläche, bezogen auf unbehandelte, infizierte Kontrollpflanzen (= 100 % Befall). Die Ergebnisse zeigt die nachstehende Tabelle II.

### 20 Tabelle II

	Verb. gem.	mit Weizenm % bei mg	ehltau bes . Wirkstof	allene Blat f/Liter Spr	tfläche in itzbrühe
	Bei- spiel	500	250	125	
25	·			•	
	2	0	0	0	
•	3	0 .	0	0	
	5 .	0	0	0	
	6	0	o	0.	0
30	9	0	0	0	
	10	: 0	0	0	
	11	0	0	0	
	12	0	0 -	0	*
	15	0	0	0	
35	16	0	0	0	
	18	0	. 0	. 0	
	19	0	0	0	

### Fortsetzung Tabelle II

5

10

15

20 -

30

35

Verb. gem. Bei-	mit Weizenmehl bei mg Wi	ltau befall rkstoff/Lit	lene Blattf ter Spritzb	läche in % rühe
spiel	. 500	250	125	
20	0	0	. 0	
21	0 .	O	0	
23	. 0	0	0	
24	0	0	. 0	a.
25	0	. 0	0	
26	0	Ο.	0	
27	. 0	. 0	0	•
30	. 0	0	0	
31	. 0	0	0	
32	6	0	. 0	
unbehande	lte,			. •
infiziert	e	100	•	_
Pflanzen		•		-

### Beispiel 2

Gerstenpflanzen wurden im 3-Blattstadium mit Konidien des Gerstenmehltaus (Erysiphe graminis sp. hordei) stark inokuliert und in einem Gewächshaus bei 20 °C und einer relativen Luftfeuchte von 90 bis 95 % aufgestellt. 3 Tage nach Inokulation wurden die Pflanzen mit den zu prüfenden Verbindungen in den Wirkstoffkonzentrationen von 500, 250 und 125 mg/Liter Spritzbrühe tropfnaß gespritzt. Nach einer Inkubationszeit von 10 Tagen wurde der Befall mit Gerstenmehltau untersucht. Der Befallsgrad wird ausgedrückt in % befallener Blattfläche, bezogen auf unbehandelte, infizierte Kontrollpflanzen (= 100 % Befall). Die Ergebnisse zeigt Tabelle III.

Tabelle III

	Verbindung gemäß Beispiel	mit Gerst in % bei brühe	enmehlt	au befallen Wirkstoff/	e Blattfl Liter Spr	äche itz-
5	Berspier	brune	500	250	125	
	-		0	. 0	0 - 3	
	5					
	7		0	0	0	1
	11	į	0	0	0	
10	12		0	. 0	0	
	15		0	0	0	
	18		0	0	0	~
	19		0 .	0	0	
	20		0	0	0	
15	21	•	0	. 0	0	
	23		0	0	0	
	24		0	0	.0	
	25	·	o	0	0	1
	26		0	. 0	0	
20	27		0	0	0	l
	30	1	0	-0	0	1
	31		0	0	0	1
	32		0	0	0	1
	33		0	0	0	
25	34		0	0	0	
	unbehan-					
	delte,			100		
	infi-				•	
-	zierte	-   -			_	
. 30	Pflanzen			·		

### Beispiel 3

Gurkenpflanzen (Sorte Delikateß) wurden im 2-Blattstadium mit einer Konidiensuspension von Gurkenmehltau (Erysiphe cichoracearum) stark inokuliert. Nach
einer Antrocknungszeit der Sporensuspension von 30
Minuten wurden die Pflanzen in einem Gewächshaus bei
22 °C und 90 % relativer Luftfeuchte aufgestellt. 3
Tage nach Infektion wurde mit den zu prüfenden Verbindungen in den in Tabelle IV angegebenen Wirkstoffkonzentrationen tropfnaß gespritzt. Nach 10 Tagen erfolgte
die Bonitur. Der Befallsgrad wird ausgedrückt in % befallener Blattfläche, bezogen auf unbehandelte, infizierte Kontrollpflanzen (= 100 % Befall). Tabelle IV
zeigt die Ergebnisse.

Tabelle IV

10

::0

	•				
Verbindung	. mit G	urkenmehlt	au befallen	e Blattfl	äche in
gemäß	% bei	mg Wi	rkstoff/Lit	er Spritz	brühe
Beispiel		500	250	125	
5		Q	. 0	0	
6		0	0	0	
10	.] ;	. 0	0	0	
12.		О .	0	0	
15 .		. 0	0	0	
18		. 0	0	0	•
19		0	. 0	0	
20		• . 0	0	0	•
21		0	0.	0	
23		0	0	0	
25		. 0	0	0	
26		. 0	0	. 0	
27		0	0	0	
29		0 .	0	0	
	1			-	

### Fortsetzung Tabelle IV

cibindung	mit Gurl	cenmehlta	u befaller	ne Blattfläche
gemäß	in % be:	i mg	Wirkstoff,	Liter Spritz-
Beispiel	brühe	500	250	125
31		0	o	ö
32		0	0	0
33		0	0	0 .
34	·.	0	0	0
35		0	0 .	0.
ınbehan-		<u></u>		
delte,			100	
infizierte	•		•	
Pflanzen				-

### Beispiel 4

5

Э

5

0

5

### Wuchshemmung an Getreide

In Schalenversuchen im Gewächshaus wurden junge Getreidepflanzen (Weizen, Gerste und Roggen) im 3-Blattstälum mit den in Tabelle I genannten Verbindungen in den angegebenen Wirkstoffkonzentrationen (kg/ha) tropfnaß gespritzt.

Nachdem die unbehandelten Kontrollpflanzen eine Wuchshöhe von etwa 55 cm erreicht hatten, wurde bei allen
Pflanzen der Zuwachs gemessen und die Wuchshemmung in
% des Zuwachses der Kontrollpflanzen berechnet. Es wurde
außerdem die phytotoxische Wirkung der Verbindungen beobachtet. Die Ergebnisse sind in der Tabelle V zusammengefaßt. Bei der Angabe der Wuchshemmung bedeuten 100 %
den Stillstand des Wachstums und 0 % ein Wachstum entsprechend dem der unbehandelten Kontrollpflanzen.

### Tabelle V

5

10

20

30

Verbin- dung gem. Bsp.	Anwen- dungs- konz. (kg/ha)	Wuchsher Weizen	mmung in	% Roggen	phytotox. Wirkung
. 5	2,5 ·1,25	21 21	· 24 24	40	keine Schäden
7	2,5	18	22	36	keine
	1,25	16	22	26	Schäden
8 .	2,5	19	30	39	keine 🕶
	1,25	12	13	36	Schäden
11	2,5	25	23 ·	37	keine
	1,25	24	22	35	Schäden
18	2,5	19	19	29	keine
	1,25	17	16	27	Schäden
19	2,5 1,25	24	23 22 ·	34 34	keine Schäden

### 25 Beispiel 5

### Wuchshemmung in Wasserreis

Reispflanzen wurden in Kleinparzellen (2 m x 2 m) angezogen und im Stadium der maximalen Bestockung mit den angegebenen Verbindungen behandelt. Die Substanzen können sowohl durch Spritzung appliziert als auch in das Wasser gegeben werden.

3 Wochen nach Behandlung wurde bei allen Pflanzen der Zuwachs gemessen und die Wuchshemmung in % des Zuwachses der Kontrollpflanzen berechnet. Es wurde außer-

0153657

Schäden

Schäden

keine

demauf eine mögliche phytotoxische Wirkung der Verbindungen geachet.

Die Ergebnisse sind in Tabelle VI zusammengefaßt. Bei der Angabe der Wuchshemmung bedeuten 100 % den Stillstand des Wachstums und 0 % ein Wachstum entsprechend der Kontrolle.

### Tabelle VI ·

5

10

25

30

35

	Verbin- dung gem. Bsp.	Anwendungs- konz. (kg/ha)	Wuchshemmung (%)	Phytotox. Wirkung
15	. 5	1,25 0,62	22 19	keine Schäden
·	7	1,25 0,62	20 17	keine Schäden
20	8	1,25 0,62	21 17	keine Schäden
	11	1,25	22 16	keine Schäden
25	18	1,25	21	keine

0,62

1,25

-0.,62

Beispiel 6

19

### Wuchshemmung an Sojabohnen

Ca. 10 cm große Sojabohnen wurden mit den Wirkstoffzubereitungen tropfnaß bespritzt. Nach 3 Wochen wird der Zuwachs gemessen und die Wuchshemmung in % des Zu-

18

21

19.

wachses der Kontrollpflanzen berechnet. Die Ergebnisse sind in Tabelle VII zusammengefaßt.

### Tabelle VII

5	Verbindung gem. Bsp.	Anwendungs- konz. (kg/ha)	Wuchshemmung (%)	Phytotox. Wirkung
10	5	2,5 1,25 0,62	68 68 52	keine Schäden
	7	2,5 1,25 0,62	55 55 49	keine Schäden
-	8	2,5 1,25 0,62	65 55 53	keine Schäden
-	19	2,5 1,25 0,62	- 62 58 56	keine Schäden

### Patentansprüche

### 1. Verbindungen der Formel (I)

$$\mathbb{R}^{1} - A - CH - \mathbb{R}^{2})_{n}$$

$$(1)$$

10 worin

5

15

20

25

A eine Carbonylgruppe oder die Gruppierung -CH(OH)-

- Phenyl das gegebenenfalls bis zu dreifach durch Halogen, Trifluormethyl, NO2, (C1-C4)Alkoxy, (C1-C4)Alkyl und/oder einfach durch Phenyl, Phenoxy oder Halogenphenoxy substituiert ist gegebenenfalls durch (C1-C4)Alkyl substituiertes Cyclo(C3-C7)alkyl oder Bicyclo(C6-C14)alkyl insbesondere [2.2.1]Bicycloheptyl, oder die Gruppierung -CHR3R4, in welcher
- R3 Wasserstoff oder (C1-C4)Alkyl, insbesondere Methyl,
  - Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)Alkyl, insbesondere Methyl, Halogen(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, Cyclo(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl,
    Bicyclo(C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)alkyl, insbesondere /2.2.1/-Bicycloheptyl,
    das durch (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl ein oder mehrfach substituiert
  - sein kann, Phenyl, Halogenphenyl, Phenyl(C1-C4)alkyl, Halogenphenyl-(C1-C4)alkyl oder
    (C1-C4)Alkoxy-carbonyl-(C1-C4)alkyl,
- Halogen, Halogen(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl oder Halogen(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy mit jeweils bis zu 5 Halogen, insbesondere Fluor oder Chlor, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl,
  Cyclo(C<sub>5</sub>-C<sub>7</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-

Alkylthio,  $(C_2-C_6)$ Alkenyloxy,  $Di(C_1-C_6)$ alkylamino, Nitro, Cyano, Hydroxy,  $(C_1-C_4)$ Alkoxycarbonyl, Phenyl, Phenoxy oder im Falle n=2 können zwei Reste  $R^2$  zusammen eine gegebenenfalls ungesättigte Kohlenwasserstoffkette mit 3 bis 4 Cahlomen bilden, die benachbarte Ringpositionen miteinander verbinden,

n 0, 1, 2 oder 3, wobei bei Mehrfachsubstitution die Reste R<sub>2</sub> verschiedene Bedeutungen besitzen können, -S(0)<sub>m</sub>R5; -NR6<sub>R</sub>7, CHR8<sub>R</sub>9,

$$(R^{10})_{m}$$
,  $(R^{10})_{m}$ ,  $(R^{10})_{m}$ ,

wobei

5

15

m 0, 1 oder 2

R<sup>5</sup>  $(C_1-C_{12})$  Alkyl, das gegebenenfalls bis zu dreifach durch Hydroxy, Halogen oder (C1-C4)Alkoxy substituiert ist, (C2-C6)Alkenyl, (C2-C6)Alkinyl, Cyclo-20  $(C_3-C_7)$  alkyl, Amino $(C_1-C_6)$  alkyl, Di $(C_1-C_6)$  alkylamino-(C1-C6)alkyl, Dicarboxy-(C1-C4)alkyl,  $R^{11}$ -O-CO-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, das im (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkylteil durch Amino substituiert sein kann, R12\_S-CO- $(C_1-C_4)Alkyl, R^6R^7N-CO-(C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_8)-$ 25 Alkanoyl, Benzoyl, Phenyl oder Benzyl, wobei die drei letztgenannten Reste gegebenenfalls ein oder zweifach durch Halogen oder eine Carboxygruppe substituiert sein können, Furfuryl oder einen fünfoder sechsgliedrigen, gegebenenfalls benzo-30 kondensierten Ring mit 1-3 Heteroatomen aus der Gruppe O, S und N, wobei der Heterocyclus durch Halogen substituiert sein kann, bevorzugt Pyridyl, mit der Maßgabe, daß für R5 = (C1-C8)Alkanoyl oder Benzoyl m = 0 sein muß, 35

- R6 Wasserstoff, (C1-C8)Alkyl, gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Phenyl,
- R7 Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)Alkyl, das gegebenenfalls bis zu dreifach durch Phenyl, Hydroxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkoxy, Cyano, Carboxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy-carbonyl substituiert ist, Amino, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl[phenyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkyl]-amino, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylidenamino, Cyclo(C<sub>5</sub>-C<sub>12</sub>)alkylidenamino, Benzylidenamino, wobei der letztgenannte Rest im Phenylkern durch Halogen, Cyano oder Phenoxy substituiert sein kann, oder

### R6 und R7

- zusammen mit dem N-Atom, das die beiden Reste trägt, einen Piperidinring oder Morpholinring, die gegebenenfalls durch (C1-C4)Alkyl substituiert sein können, insbesondere 3,5-Dimethylpiperidinyl und 3,5-Dimethylmorpholinyl, sowie einen Piperazinring, der in Position 4 durch (C2-C4)Alkanoyl, (C1-C4)Alkyl, Phenyl oder Benzyl substituiert ist, wobei die beiden letztgenannten Reste durch Halogen oder CF3 substituiert sein können,
- 25  $R^8$ ,  $R^9$  unabhängig voneinander ( $C_1-C_3$ ) Alkanoyl, Benzoyl, ( $C_1-C_3$ ) Alkoxycarbonyl oder Cyano,
  - $R^{10}$  (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl,
- 30 R<sup>11</sup> H, (C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>)Alkyl, das gegebenenfalls bis zu dreifach durch Halogen, vorzugsweise Fluor, Chlor, oder Brom, Hydroxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkoxy-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkylamino, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, Phenyl oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy-carbonyl substituiert ist, Cyclo(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)alkyl,

5

10

15

25

30

(C3-C6)Alkenyl, Halogen(C3-C6)alkenyl, Cyclo-(C5-C6)alkenyl, (C3-C4)Alkinyl, das gegebenenfalls ein- oder zweifach durch (C1-C6)-Alkyl, Phenyl, Halogen oder (C1-C2)Alkoxy substituiert ist, Phenyl, das gegebenenfalls ein-bis dreifach durch (C1-C4)\_Alkyl, (C1-C4)Alkoxy, Halogen, NO2 oder CF3 substituiert ist, Furfuryl, Tetrahydrofurfuryl oder ein Kationäquivalent einer organischen oder anorganischen Base, insbesondere NH4, Mono-, Di-, Tri(C1-C4)alkylammonium, Benzyl-tri(C1-C4)alkylammonium, Natrium oder Kalium,

R12 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl, Phenyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>) alkyl, wobei der
Phenylrest ein- oder zweifach durch (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl
oder Halogen substituiert sein kann, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)Alkenyl oder Phenyl, das ein- oder zweifach durch
(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl oder Halogen substituiert sein kann,

bedeuten, sowie deren pflanzenverträgliche Metall-20 salzkomplexe, Säureadditionsverbindungen und Quaternisierungsprodukte.

> 2. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man eine Verbindung der Formel (II)

$$R^{1} - C - C = CH - (R^{2})_{n}$$
(II)

mit einer Verbindung der Formel (III),

 $H-X^{\dagger}$  (III)

worin X' die für X genannten Reste mit Ausnahme von
-SOR<sup>5</sup> und -SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup> bedeutet, umsetzt, die erhaltenen
Verbindungen der Formel (I), worin A eine Carbonylgruppe
bedeutet, gegebenenfalls reduziert, die erhaltenen
Verbindungen der Formel (I) im Falle X = SR<sup>5</sup> gegebenenfalls zu Verbindungen der Formel (I) mit X = SOR<sup>5</sup> oder
SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup> oxidiert und die Verbindungen der Formel I gegebenenfalls in ein Säureadditionssalz, Komplexsalz
oder Quaternisierungsprodukt überführt.

- 3. Pflanzenwuchsregulierende und fungizide Mittel, gekennzeichnet durch einen wirksamen Gehalt an einer Verbindung gemäß Anspruch 1.
- 4. Verwendung von Verbindungen gemäß Anspruch 1 als Fungizide oder Wachstumsregulatoren.

15

- 20 5. Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, daß man auf die zu schützenden Pflanzen, Pflanzenteile oder Anbauflächen eine Verbindung gemäß Anspruch 1 aufbringt.
- 6. Verfahren zur Wachstumsregulierung von Kulturpflanzen, dadurch gekennzeichnet, daß man auf die zu schützenden Pflanzen, Pflanzenteile oder Anbauflächen eine Verbindung gemäß Anspruch 1 aufbringt.

### EUROPÄISCHER RECHERCHENBERICHT

		IGE DOKUMENTE		EP 85101520.6
Katagoria	Kennzeichnung des Dokumen der maßg	ts mit Angabe, soweit erforderlich, eblichen Telle	Betrifft Anspruch	KLASSIFIKATION DER ANMELDUNG (Int. Cl.4)
D,A	EP - A2 - 0 092 7	730 (BASF)	1,3	C 07 D 249/08 C 07 D 401/06
D,A	EP - A1 - 0 059 8 * Zusammenfass	•	1,3	C 07 D 401/12 C 07 D 403/06 C 07 D 405/12
A	DE - A1 - 2 604 3 * Formel I *	BOS (BAYER)	1,4	A 01 N 43/65
·A	DE - A1 - 3 151 4  * Anspruch 1 *		1	
· A	DE - A1 - 3 139-2  * Zusammenfass	<del>-</del>	1,3	
A	DE - A1 - 3 200 4  * Formel I *	14 (BAYER)	1,3,4	C 07 D 249/00 C 07 D 401/00
A	EP - A1 - 0 068 1  * Formel I *	44 (HOECHST)	1,4	C 07 D 403/00 C 07 D 405/00
Derv	rorliegende Recherchenbericht wurde (	für alle Patentansprüche erstellt.		
	Recherchenort WIEN	Abschlußdatum der Recherche 30-04-1985		Prüfer HAMMER

A: technologischer Hintergrund
 inchtschriftliche Offenberung
 Zwischenliteratur
 der Erfindung zugrunde liegende Theorien oder Grundsätze

L: aus andern Gründen angeführtes Dokument

&: Mitglied der gleichen Patentfamilie, übereinstimmendes Dokument